

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : **03-261708**
 (43)Date of publication of application : **21.11.1991**

(51)Int.CI.

A61K 7/06

(21)Application number : **02-057339**
 (22)Date of filing : **08.03.1990**

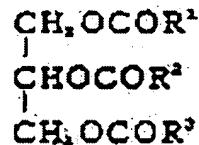
(71)Applicant : **LION CORP**
 (72)Inventor : **NISHIDA YUICHI**

(54) HAIR GROWER

(57)Abstract:

PURPOSE: To obtain a hair grower improved in low-temperature stability and hair growing effect by incorporating specific fatty acid (s) and/or aliphatic alcohol (s) with medium chain fatty acid triglyceride (s) noncrystalline at normal temperatures at specified proportion.

CONSTITUTION: The objective hair grower containing, as the essential components, (A) at least one compound selected from (1) straight or branched chain fatty acids having an 8-28C alkyl group with even number of carbon atoms, straight or branched chain aliphatic alcohols having 9-29C carbon chain length with odd number of carbon atoms, their salts and derivatives and (B) at least one of medium chain fatty acid triglycerides noncrystalline at normal temperatures of the formula (R1, R2, R3 are each 5-11C straight or branched chain alkyl with odd number of carbon atoms). The proportions of the amounts of the components A and B to the whole amount of the final product are as follows: A =0.1-15wt.%, and B=0.1-20wt.%. The present hair grower is good in low-temperature stability, causing no opacification or crystal deposition even at low temperatures such as ca.-5°C, with the active ingredient (s) percutaneously absorbed in high efficiency, thus having excellent hair growing effect.



LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

⑫ 公開特許公報 (A)

平3-261708

⑤Int.Cl.⁵
A 61 K 7/06識別記号
厅内整理番号
7038-4C

⑬公開 平成3年(1991)11月21日

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全6頁)

④発明の名称 養育毛料

②特 願 平2-57339
②出 願 平2(1990)3月8日⑦発明者 西田 勇一 東京都墨田区本所1丁目3番7号 ライオン株式会社内
⑧出願人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号
⑨代理人 弁理士 小島 隆司

明細書

1. 発明の名称

養育毛料

2. 特許請求の範囲

1. 炭素数8～28の直鎖及び分岐鎖の偶数の炭素鎖長のアルキル基を有する脂肪酸及び炭素数9～29の直鎖及び分岐鎖の奇数の炭素鎖長を有する脂肪族アルコール並びにこれらの塩及び誘導体から選ばれる1種又は2種以上を全体の0.1～15重量%と、下記一般式〔1〕



(但し、式中R¹、R²、R³は炭素数5～11の直鎖又は分岐鎖の奇数炭素鎖長のアルキル基である。)

で示される常温で非晶質の中鎖脂肪酸トリグリセリドの1種又は2種以上を全体の0.1～2.0重量%含有することを特徴とする養育毛料。

3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は、低温安定性が良好であり、かつ、優れた養育毛効果を有する養育毛料に関する。

従来の技術及び発明が解決しようとする課題

従来、炭素数8～28の直鎖及び分岐鎖の偶数の炭素鎖長のアルキル基を有する脂肪酸及び炭素数9～29の直鎖及び分岐鎖の奇数の炭素鎖長を有する脂肪族アルコール並びにこれらの塩及び誘導体に養育毛効果があることが知られており、これらを有効成分として含有する養育毛剤が特開昭59-27809号公報等に提案されている。

しかしながら、上述した脂肪酸などの有効成分は、一般に炭素数が大きくなればなるほど溶解度が低くなる。このため、上記有効成分を含有する養育毛料は、低温で白濁又は結晶が析出するといった不都合が生じる場合があり、それ故、養育毛効果の低下も懸念されるもので、低温安定性を向上させることが要望されている。

また、商品価値上、養育毛料は冬期における一

5℃程度の低温から真夏における40℃又はそれ以上の高温度下の保管条件においても、白濁や結晶析出がなく安定であることに加え、養育毛成分をその作用部位に十分に吸収させて、養育毛効果をより向上させることも望まれている。

本発明は上記事情に鑑みなされたもので、低温安定性に優れ、かつ、優れた養育毛効果を有する養育毛料を提供することを目的とする。

課題を解決するための手段及び作用

本発明者は上記目的を達成するため鋭意検討を重ねた結果、養育毛成分として炭素数8～28の直鎖及び分岐鎖の偶数の炭素鎖長のアルキル基を有する脂肪酸及び炭素数9～29の直鎖及び分岐鎖の奇数の炭素鎖長を有する脂肪族アルコール並びにこれらの塩及び誘導体から選ばれる1種又は2種以上を全体の0.1～15%（重量%、以下同様）配合すると共に、下記一般式〔I〕



本発明の養育毛料に配合される脂肪酸、脂肪族アルコール、及びそれら塩、誘導体は、炭素鎖を構成する炭素原子の数が上記したものであれば、その炭素鎖は飽和、不飽和のいずれでもよく、更に、不飽和鎖の場合、複数の二重結合を含んでいてもよい。

ここで、上記脂肪酸としては、例えばノナン酸、ウンデカン酸、トリデカン酸、ペンタデカン酸、ヘプタデカン酸、ノナデカン酸、ヘンエイコサン酸、トリコサン酸、ペンタコサン酸、ヘプタコサン酸等が挙げられる。その塩としてはこれらのアルカリ金属塩、アンモニウム塩、有機アミン塩等がある。

また、脂肪族アルコールとしては、具体的にノナノール、ウンデカノール、トリデカノール、ペンタデカノール、ヘプタデカノール、ノナデカノール、ヘンエイコサノール、トリコサノール、ペンタコサノール、ヘプタコサノール等が例示される。

更に、上記脂肪酸又は脂肪族アルコールの誘導

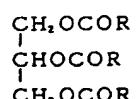
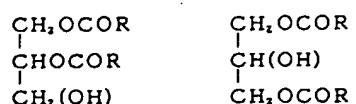
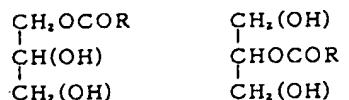
（但し、式中R¹、R²、R³は炭素数5～11の直鎖又は分岐鎖の奇数鎖長のアルキル基である。）で示される常温で非晶質の中鎖脂肪酸トリグリセリドの1種又は2種以上を全体の0.1～20%配合することにより、前記脂肪酸等の養育毛成分の低温安定性が著しく向上し、-5℃程度の冬期の温度においても白濁や結晶析出がなく、しかも、養育毛成分が効率良く経皮に吸収され、優れた毛髪の成長促進作用を示して養育毛効果も向上し、それ故、低温安定性が良好であり、かつ、優れた養育毛効果を有する養育毛料が得られることを知見し、本発明をなすに至った。

以下、本発明につき更に詳述する。

本発明の養育毛料は、上述したように炭素数8～28の直鎖及び分岐鎖の偶数の炭素鎖長のアルキル基を有する脂肪酸及び炭素数9～29の直鎖及び分岐鎖の奇数の炭素鎖長を有する脂肪族アルコール並びにこれらの塩及び誘導体から選ばれる1種又は2種以上と上記〔I〕式の中鎖脂肪酸トリグリセリドを配合したものである。

体としては、例えば下記（イ）～（ヌ）の結晶性化合物が挙げられる。

（イ）下記式で示されるグリセリンエステル



（但し、Rは炭素数8～30の偶数鎖長のアルキル基である。以下同様。）

（ロ）下記式で示されるエステル



（但し、-O-R'はメタノール、エタノール等の1価もしくは2価のアルコール残基、ポリオキシエチレン残基、ソルビタン残基、又はショ糖残

基を表わす。)

(ハ) 下記式で示されるアミド



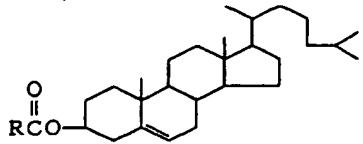
(但し、R''、R'''はそれぞれ水素原子又は有機基、例えばアミノ酸残基、アルキル基、アルケニル基、フェニル基である。)

(ニ) 下記式で示される二塩基酸及びその塩

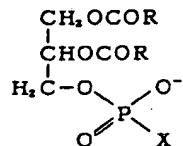


(但し、Mはアルカリ金属原子、アルカリ土類金属原子、アンモニウム又は有機アミンである。)

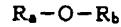
(ホ) 下記式で示されるステロールエステル



(ヘ) 下記式で示されるリン脂質

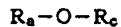


(リ) 下記式で示されるエステル



(但し、R_aは炭素数9～29の奇数鎖長のアルキル基（以下同様）であり、-O-R_bは脂肪酸残基（好ましくは炭素数2～24の鎖長を有するもの）；コハク酸、クエン酸、フマル酸、乳酸、ビルビン酸、リンゴ酸、オキザロ酢酸のような有機酸の残基；又はリン酸等の無機酸の残基を示す。)

(ヌ) 下記式で示されるエーテル

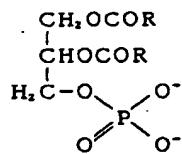


(但し、-O-R_cは1価アルコール残基（好ましくは炭素数2～24の鎖長を有するもの）；グリセリン、ポリグリセリン、エチレングリコール、プロピレングリコール、ブタンジオールのような多価アルコールの残基；又はブドウ糖、リボース、ガラクトース、アラビノース、マンノース、キシロース、ソルビトール、マンニトールのような糖の残基を示す。)

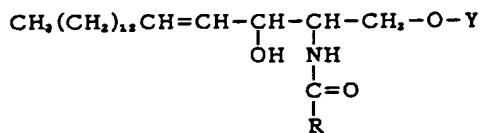
本発明の養育毛料において上記脂肪酸等の配合

（但し、Xはコリン残基、エタノールアミン残基、セリン残基、又はイノシトール残基を表わす。Xがコリン残基のときはfosfatidylcholine、エタノールアミン残基のときはfosfatidylethanolamine、セリン残基のときはfosfatidylserine、イノシトールのときはinositolとなる。）

(ト) 下記式で示されるfosfatidin酸



(チ) 下記式で示されるスフィンゴ脂質



(但し、-O-Yは糖残基、リン酸残基、又はコリンもしくはエタノールアミンのようなアミン塩基残基を表わす。)

量は、全体の0.1～15%、好ましくは0.5～5%であり、配合量が0.1%未満では養育毛効果が低く、また、15%を越えて配合してもその養育毛効果はほとんど変わらず、不経済である。

次いで、本発明の養育毛料に配合する中鎖脂肪酸トリグリセリドは、下記一般式〔I〕



(但し、式中R¹、R²、R³は炭素数5～11の直鎖又は分岐鎖の奇数鎖長のアルキル基である。)で示されるもので、常温で非晶質のもの（即ち液体、ガラス状固体）が用いられる。

この場合、〔I〕式の中鎖脂肪酸トリグリセリドとして具体的には、ヘキサン酸トリグリセリド、オクタン酸トリグリセリド、デカン酸トリグリセリド、ドデカン酸トリグリセリド、イソヘキサン酸トリグリセリド、イソオクタン酸トリグリセリド、イソデカン酸トリグリセリド、イソドデカン

酸トリグリセリド、ジヘキサン酸モノアセトグリセリド、ジオクタン酸モノデカン酸グリセリド等を挙げることができ、これらの1種又は2種以上を使用することができる。

また、(1)式の中鎖脂肪酸トリグリセリドの配合量は、全体の0.1~10%、好ましくは0.5~5%であり、配合量が0.1%未満では養育毛促進効果が低下し、10%を越えると養育毛料の低温での保存安定性が低下する。

本発明の養育毛料に溶媒を使用する場合は、特に限定されず、上記成分が溶解可能な溶媒であれば、水、有機溶媒のいずれのものも使用し得、有機溶媒は親水性溶媒でも親油性溶媒でもよいが、特に水分量が20%以下、特に5%以下の非水溶媒が好適に使用し得る。このような非水溶媒として具体的には、メチルアルコール、エチルアルコール、プロピルアルコール、イソプロピルアルコール、グリセリン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、n-パラフィン、ベンゼン、ヘキサン、クロロホルム等が例示されるが、特に

も重量%である。

また、各例に先立ち、各例で採用した経皮吸収促進効果測定法及び低温安定性の評価方法について説明する。

経皮吸収促進効果測定法

ドナー部とリセプター部の2部品の間に皮膚をはさんで用いる構成となっている経皮吸収試験用垂直型拡散セルを用い、皮膚材料にはモルモットの皮膚(4週齢、雄、毛刈3日後)を用いた。

3%経皮吸収促進剤(C15の位置の炭素をC¹⁴でラベルしたペントデカン酸モノグリセライド)を製剤に配合して投与検体とし、これを皮膚材料に投与した後、32℃で24時間インキュベートし、次に1或エタノールで10回皮膚表面を洗浄し、更に皮膚溶解して皮膚中の放射活性をカウントし、そのカウント値を皮膚中量とした。また、同様にリセプター液中の放射活性をカウントし、そのカウント値を皮膚透過量とした。

経皮吸収促進剤なしの時の皮膚中量及び皮膚透過量を100として経皮吸収剤を含む検体の各値

低級アルコール、多価アルコールが好ましく、とりわけこれらのうちで安全性の高いエチルアルコールを使用することが好適である。

本発明の養育毛料には、必要に応じてその他の任意成分を本発明の効果に影響のない範囲で配合することができる。この場合、任意成分は剤型に応じた種々の公知成分が配合でき、例えば高分子物質、油分、色素、香料などが挙げられる。

発明の効果

本発明の養育毛料は、低温安定性に優れ、-5℃程度の冬期の温度においても白濁や結晶析出がなく、しかも、養育毛成分が効率良く経皮に吸収されて高い毛髪の成長促進作用を示し、優れた養育毛効果を有する。それ故、本発明品は商品価値が高いもので、各種育毛剤、ヘアトニック、ヘアリキッド、プロートリートメント等として有効に利用することができる。

以下、実施例及び比較例を挙げて本発明を具体的に説明するが、本発明は下記実施例に制限されるものではない。なお、各例において%はいずれ

を表わした。

低温安定性の評価方法

被試験試料約50gを透明ガラスびんに取り、-5℃の恒温室に保存して、結晶が析出した日から1日引いた日数を安定化日数とした。なお、結果は3回の測定結果の平均日数を四捨五入した日数で表わした。

また、低温安定性は、安定化日数が28日以上の場合を○、14~27日の場合を△、13日以下の場合を×として評価した。

[実施例1~9、比較例1~8]

第1表に示す組成の育毛剤を調製し、経皮吸収促進効果と低温安定性を評価した。結果を同表に併記する。

第 1 表

組成 (%)	実施例					比較例		実施例					比較例					実施例		
	1	2	3	4	5	1	6	2	3	4	5	6	7	8	7	8	9			
モノペンタデカン酸グリセリン	3.0																	1.5		1.5
トリデカン酸		3.0																		
ペンタデカン酸イソプロピル			3.0					3.0			0.01	30	3.0	3.0	1.5	3.0	1.5			
ペンタデカン酸コレステロール				3.0																
ノナン酸グリセリド					3.0															
ミリスチン酸グリセリド						3.0				3.0										
ヘプタデシルアルコール							3.0													
オクタン酸トリグリセリド	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0			5.0	5.0	5.0	0.1	30	5.0	2.5	2.5			
デカン酸トリグリセリド																		2.5	2.5	
モノラウリン酸ソルビタン	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0			
エタノール	残部																			
計	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	
経皮吸収促進効果	120	114	110	108	113	121	119	115	110	—	104	122	117	121	116	118	113			
低温安定性	●	●	●	●	●	●	○	×	○	●	●	×	×	×	×	×	●	●	●	
総合評価	●	●	●	●	●	×	○	×	×	×	×	×	×	×	×	×	●	●	●	

第1表から、本発明の範囲内の2種の有効成分を所定量含む試験試料（実施例1～9）は、いずれも養毛効果及び低温安定性において優れた特性を示しているのに対し、本発明の範囲外の試験試料（比較例1～8）は、いずれも優れた特性を示していないことがわかる。即ち、本発明に係る養育毛有効成分を含まない試験試料（比較例1、3、4）及びそれらの含有量が少なすぎる試験試料（比較例5）は養毛効果に問題があり、また、奇数炭素鎖長を有する有効成分を含んでいても、

[I]式の中鎖脂肪酸トリグリセリドを含まないかもしくは本発明の範囲外の配合量の試験試料（比較例2、6、7、8）は低温安定性において問題があった。

次に、本発明の養毛化粧料を実際の製品に適用した処方例を示す。いずれの例においても優れた特性を示すことが確認された。

[実施例10] 育毛剤

ペンタデカン酸グリセリド 3.0%
(モノグリセリド：99%，
ジグリセリド：1%)

ヘキサン酸トリグリセリド	3.0
酢酸d<-α-トコフェロール	0.2
ビオチン	0.01
ヒノキチオール	0.05
メタクリル酸エステル共重合体の 両性化合物	0.1
モノラウリン酸ソルビタン	5.0
香料	0.5
9.5%エタノール	残部
計	100.0%
(実施例11) ヘアトニック	
ペンタデカン酸イソプロピル/ ペンタデカン酸(98/2)	0.5%
ドデカン酸トリグリセリド	2.0
イソプロピルメチルフェノール	0.1
2-メントール	0.2
ニコチン酸ベンジル	0.003
香料	0.3
9.5%エタノール	40.0
精製水	残部
計	100.0%

〔実施例12〕ヘアリキッド

トリデシルアルコール	1.0%
(トリデシルアルコール: 98%, トリデカン酸: 2%)	
オクタン酸トリグリセリド/ デカン酸トリグリセリド (70/30)	2.0%
ポリオキシプロピレンポリオキシ エチレンブチルエーテル	5.0
メタクリル酸エステル共重合体の 両性化合物	0.3
香 料	0.3
95%エタノール	30.0
精 製 水	残 部
計	100.0%

〔実施例13〕エアゾール育毛剤

(原 液)

ペンタデカン酸グリセリド	2.0%
オクタン酸トリグリセリド/ デカン酸トリグリセリド (30/70)	3.0
酢酸d ₂ -α-トコフェロール	0.3
センブリ抽出ペースト	0.1
ムーメントール	0.1
ビオチン	0.03

香 料	0.4
メチルパラベン	0.1
プロビルパラベン	0.1
精 製 水	残 部
計	100.0%

〔実施例15〕プロートリートメント

ペンタデカン酸	0.5%
ジオクタン酸モノドデカン酸 グリセリド	1.0
塩化ステアリルトリメチル アンモニウム	0.3
ポリオキシプロピレンポリオキシ エチレンブチルエーテル	0.3
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油	0.3
エタノール	30.0
精 製 水	残 部
計	100.0%

グリチルリチン酸モノアンモニウム	0.1
香 料	0.4
エタノール	30.0
精 製 水	残 部
計	100.0%

(充填用希釈液)

原 液	4.0
フロン12	2.4
フロン114	2.4
LPG	1.2

計 100.0%

〔実施例14〕養毛料クリーム

ノナン酸グリセリド	3.0
ジヘキサン酸モノアセトグリセリド	2.0
センブリエキス	0.1
ステアリルアルコール	2.0
塩化セチルトリメチルアンモニウム	0.3
POE(40)モノステアレート	4.0
イソプロピルミリストート	5.0
プロピレングリコール	5.0

出願人 ライオン株式会社

代理人 弁理士 小島隆司

(他1名)